

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005年2月17日 (17.02.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/013966 A1(51) 国際特許分類⁷: A61K 31/222, 31/336, A61P 1/00, 1/02, 1/04, 3/10, 7/00, 9/10, 11/00, 11/06, 17/00, 19/02, 25/00, 25/16, 25/28, 29/00, 31/00, 31/04, 31/12, 31/16, 31/18, 31/22, 33/00, 35/00, 37/04, 37/06, 37/08, 43/00, C07M 7/00, C07D 303/36

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/011260

(22) 国際出願日: 2004年8月5日 (05.08.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2003-288280 2003年8月6日 (06.08.2003) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 学校法人慶應義塾 (KEIO UNIVERSITY) [JP/JP]; 〒1080073 東京都港区三田2丁目15番45号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 梅澤一夫 (UMEZAWA, Kazuo) [JP/JP]; 〒2230061 神奈川県横浜市港北区日吉3丁目14番1号 慶應義塾大学理工学部内 Kanagawa (JP). 鈴木絵里子 (SUZUKI, Eriko) [JP/JP]; 〒2230061 神奈川県横浜市港北区日吉3丁目14番1号 慶應義塾大学理工学部内 Kanagawa (JP).

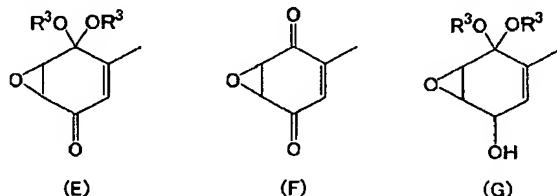
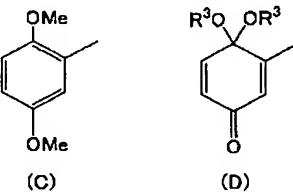
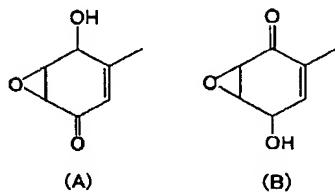
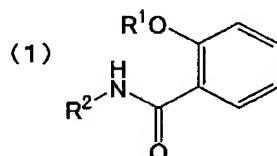
(74) 代理人: 一色国際特許業務法人 (ISHIKI & CO.); 〒1050004 東京都港区新橋2丁目12番7号 労金新橋ビル Tokyo (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,

(統葉有)

(54) Title: MACROPHAGE ACTIVATION INHIBITOR

(54) 発明の名称: マクロファージ活性化阻害剤



(57) Abstract: Compound of the general formula: (1) (wherein R¹ is hydrogen or C₂-C₄ alkanoyl; and R² is any of the groups represented by the formulae: (A) to (G) (wherein R³ is C₁-C₄ alkyl)) is capable of inhibiting macrophage activation. Therefore, the macrophage activation inhibitor comprising a compound of the general formula (1) or a pharmacologically acceptable salt thereof as an active ingredient is useful as a medical agent for prevention, amelioration and treatment of diseases attributed to infection with pathogens such as bacterial and viruses.

(統葉有)

WO 2005/013966 A1



**SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW,**

BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG.

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,

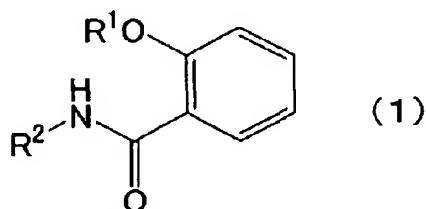
添付公開書類:
一 國際調查報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCT gazetteの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドスノート」を参照。

(57) 要約:

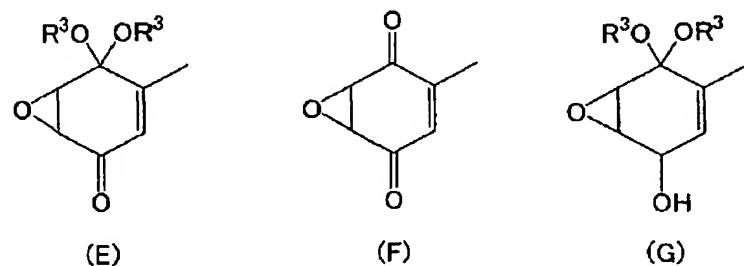
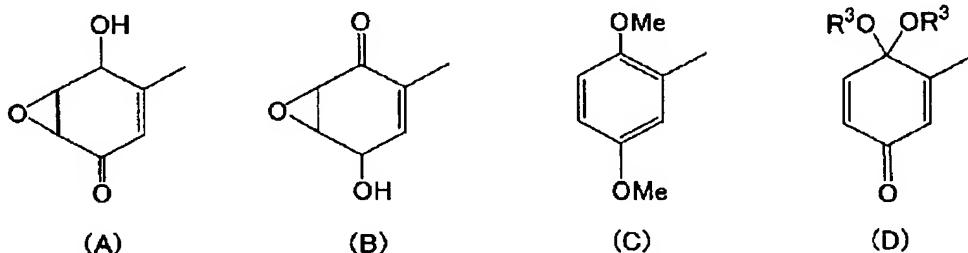
下記の一般式(1)

【化1】



(式中、R¹は水素原子またはC2～4のアルカノイル基であり、R²は下記の式(A)から(G)のいずれかで表される基である。)

【化2】



(式中、R³はC1—4のアルキル基である。)

で表される化合物は、マクロファージの活性化を阻害することができる。従って、一般式(1)で表される化合物またはその薬理学的に許容される塩を有効成分として含有するマクロファージ活性化阻害剤は、細菌やウイルスなどの病原体の感染に起因する疾患を予防、改善または治療のための薬剤として有用である。